

Cosmetic compsns. having antioxdation properties - include raffinose ester(s) of fatty acids and tri:terpene alcohol ester(s) of ferulic acid

Patent Number : JP59067215

International patents classification : A61K-007/00 A61K-031/19

• Abstract :

JP59067215 A The compsns. (I) comprise raffinose esters (II) of 14-20C higher fatty acids with triterpene alcohol esters (III) of ferulic acid, sugar fatty acid esters (IV) and solcoseryl (V). In (II), the fatty acid is myristic acid or stearic acid. (III) may comprise more than 50% of cycloartenol or 2,4-methylenecycloartenol. (III) may consist of more than 1% of cycloeucarenol, more than 10% of cycloartenol, more than 10% of 2,4-methylenecycloartenol and more than 1% of cyclobral.

Other new cosmetic compsns. (IV) are mixtures of (II) with oil-soluble assistant-predissolved (III), (IV) and (V). The assistant may be an ethyl ester of a 20C or more fatty acid or a glyceride of an unsatd. fatty acid derived from rice bran oil. Wheat germ oil may be used as the assistant, and further diluted with 1,3-butylene glycol before dissolution of (III).

(I) and (VI) have antioxdn. properties, with reduced effect of ultraviolet rays on their polyunsatd. fatty acids, and are useful e.g. as creams or lotions for the skin.

• Publication data :

Patent Family : JP59067215 A 19840416 DW1984-21 11p * AP:

1982JP-0178905 19821012

Priority n° : 1982JP-0178905 19821012

Covered countries : 1

Publications count : 1

• Patentee & Inventor(s) :

Patent assignee : (SUGA/) SUGA K

• Accession codes :

Accession N° : 1984-131227 [21]

Sec. Acc. n° CPI : C1984-055601

• Derwent codes :

Manual code : CPI: D04-B09 D06-H D09-

E E01 E07-A02 E10-A07

Derwent Classes : D21 E19

• Update codes :

Basic update code : 1984-21

THIS PAGE BLANK (USPTO)
10/11/2012 10:12:12 AM

XP-002211711

AN - 1984-131227 [25]

AP - JP19820178905 19821012

CPY - SUGA-I

DC - D21 E19

FS - CPI

IC - A61K7/00 ; A61K31/19

MC - D04-B09 D06-H D09-E E01 E07-A02 E10-A07

M3 - [01] F012 F013 F014 F015 F016 F017 F019 F113 F123 F199 H4 H405 H424
H482 H5 H522 H8 J0 J011 J2 J271 K0 L8 L814 L815 L818 L823 L831 M1 M126
M141 M225 M231 M232 M233 M262 M281 M311 M323 M342 M373 M393 M413 M510
M523 M530 M540 M782 M903 Q254 Q623 Q624 R021 R022 R023

- [02] H4 H404 H484 H8 J0 J011 J2 J271 J4 J471 K0 L8 L814 L821 L831 M225
M231 M232 M233 M262 M281 M315 M321 M332 M344 M349 M381 M391 M416 M620
M782 M903 Q254 Q623 Q624 R021 R022 R023

M5 - [03] M782 M903 Q254 Q623 Q624 R021 R022 R023 S023 S131 S132 S133 S134
S142 S204 S214 S303 S304 S317 S500 S703 S730 S732 S733 S734 S762 S800
S830 T804 T814 U004 U030 U102 U104 U109 U110 U133 U134 U141 U150 U560
U563 U564 U581

PA - (SUGA-I) SUGA K

PN - JP59067215 A 19840416 DW198421 011pp

PR - JP19820178905 19821012

RR - 05399 57508

XA - C1984-055601

XIC - A61K-007/00 ; A61K-031/19

AB - J59067215 The compsns. (I) comprise raffinose esters (II) of 14-20C
higher fatty acids with triterpene alcohol esters (III) of ferulic
acid, sugar fatty acid esters (IV) and solcoseryl (V). In (II), the
fatty acid is myristic acid or stearic acid. (III) may comprise more
than 50% of cycloartenol or 2,4-methylenecycloartenol. (III) may
consist of more than 1% of cycloeucarenol, more than 10% of
cycloartenol, more than 10% of 2,4-methylenecycloartenol and more than
1% of cyclobral.

- Other new cosmetic compsns. (IV) are mixtures of (II) with oil-soluble
assistant-predissolved (III), (IV) and (V). The assistant may be an
ethyl ester of a 20C or more fatty acid or a glyceride of an unsatd.
fatty acid derived from rice bran oil. Wheat germ oil may be used as
the assistant, and further diluted with 1,3-butylene glycol before
dissolution of (III).

- (I) and (VI) have antioxidn. properties, with reduced effect of
ultraviolet rays on their polyunsatd. fatty acids, and are useful e.g.
as creams or lotions for the skin.

IW - COSMETIC COMPOSITION ANTIOXIDANT PROPERTIES RAFFINOSE ESTER FATTY ACID
TRI TERPENE ALCOHOL ESTER FERULIC ACID
IKW - COSMETIC COMPOSITION ANTIOXIDANT PROPERTIES RAFFINOSE ESTER FATTY ACID
TRI TERPENE ALCOHOL ESTER FERULIC ACID

NC - 001

OPD - 1982-10-12

ORD - 1984-04-16

PAW - (SUGA-I) SUGA K

TI - Cosmetic compsns. having antioxidation properties - include raffinose
ester(s) of fatty acids and tri:terpene alcohol ester(s) of ferulic

THIS PAGE BLANK (USPTO)

⑬ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭59—67215

⑤ Int. Cl.³
A 61 K 7/00
// A 61 K 31/19

識別記号
A D A

庁内整理番号
7306—4 C
7330—4 C

⑬ 公開 昭和59年(1984)4月16日

発明の数 2
審査請求 未請求

(全 11 頁)

⑭ 化粧品組成物

⑯ 特 願 昭57—178905
⑰ 出 願 昭57(1982)10月12日
⑱ 発 明 者 須賀一雄

東京都荒川区東尾久3の30の2
⑲ 出 願 人 須賀一雄
東京都荒川区東尾久3の30の2
⑳ 代 理 人 弁理士 塩崎正広

明 細 書

1. 発明の名称

化粧品組成物

2. 特許請求の範囲

1 フェエルラ酸のトリテルペンアルコールエステルを溶解せる炭素数14—20の高級脂肪酸のラフィノーズエステル及び蔗糖脂肪酸エステルを配合し、さらにソルコセリルを配合することを特徴とする化粧品組成物。

2 高級脂肪酸としてミリスチン酸、ステアリン酸又はその1つを使用したラフィノーズエステルを用いた特許請求の範囲第1項記載の組成物。

3 フェエルラ酸のトリテルペンアルコールエステルが2,4メチレンシクロアルタノール50%以上よりなる特許請求の範囲第2項記載の組成物。

4 フェエルラ酸のトリテルペンアルコールエ

テルがシクロアルテノール50%以上よりなる特許請求の範囲第2項記載の組成物。

5 フェエルラ酸のトリテルペンアルコールエステルの組成が

シクロオイカレノール 1%以上

シクロアルテノール 10%以上

2,4メチレンシクロアルタノール 10%以上

シクロブラノール 1%以上

よりなる特許請求の範囲第2項記載の組成物。

6 予め油溶性の補助剤に溶解した、フェエルラ酸のトリテルペンアルコールエステルを溶解せる炭素数14—20の高級脂肪酸のラフィノーズエステル及び蔗糖脂肪酸エステルを配合し更にソルコセリルを配合することを特徴とする化粧品組成物。

7 補助剤が米糠油の炭素数20以上の脂肪酸エチルエステルである特許請求の範囲第6項記載の組成物。

8 補助剤が米糠油の不飽和脂肪酸のグリセライドである特許請求の範囲第6項記載の組成

物。

- 9 補助剤として小麦胚芽油を用い、更に1,3-ブチレングリコールで稀釈したものを使用せる特許請求の範囲第6項記載の組成物。

3. 発明の詳細な説明

本発明はフェルラ酸のトリテルペンアルコールエステル（以下FAEと略称する）を溶解せる炭素数14～20の高級脂肪酸のラフィノーズエステルと蔗糖脂肪酸エステルを併用し、更にソルコセリルを配合した、変異原性がなく、皮膚刺激を与えず、使用後に肌にしつとりした感じを与え、且つ抗酸化性を有し、特に含水多不飽和酸に対する紫外線の影響を軽減することを特徴とする、pHの広い範囲にわたって安定な化粧品組成物に関するものである。

又含有するFAEのステロールの種類によつては皮膚の脂腺賦活剤としての顕著な薬理的效果を有している。

通常化粧品用クリームや乳液等に用いられる乳

(3)

り人体に対して使用感がよく、刺激性や毒性がないことが必要である。

本発明の化粧品組成物に使用したのは、炭素数14～20の高級脂肪酸のラフィノーズエステルにFAEを溶解したものと、蔗糖脂肪酸エステルとの併用で、調和のとれた高い親油性と親水性を有し、特にFAEを使用した場合の溶化、分散力が優れており、時日が経過しても析出することなく、ながく均質な製品を与えることが出来る。又これに更にソルコセリルを配合した化粧品組成物のクリーム、パック、乳液、化粧水の動物試験に於いても皮膚一次刺激性は認められず、発癌性物質検索のためのスクリーニングテストとして行なわれる微生物による修復性試験の結果に於いてもDNA損傷性はないものと認められた。

又FAEの含有により抗酸化性があり、特に含水多不飽和脂肪酸に対する紫外線の影響を軽減し、過酸化物の発生を防止するために皮膚障害が生じない。又皮膚の脂腺細胞賦活剤としても

化剤、分散剤としては第4級アンモニアの如き陽イオン活性剤、脂肪酸のアルカリ塩や高級アルコールの硫酸エステルの如き陰イオン活性剤又はレシチンの如き両性活性剤或いはソルビタン脂肪酸エステル及びポリオキシエチレン、高級アルコールエーテルの如き非イオン活性剤の単独又は併用が適用されている。乳化剤、分散剤としては親油基と親水基を適当な割合で有し、化粧品の種類によつては水中に油を、油中に水を充分に乳化し溶化し或いは分散させる機能を有すると同時に、人体に対して薬害がなく、化粧品として長く安定した状態に保つ機能を有することが必要である。一般に化粧品の変質は湿度及び光、特に紫外線等による油分と水の分離及び油脂や香料の酸化によることが多い。化粧品の原料として使用される油脂の中にも多少水分が残存し、特に含水多不飽和脂肪酸の場合は紫外線の影響を受け易い。

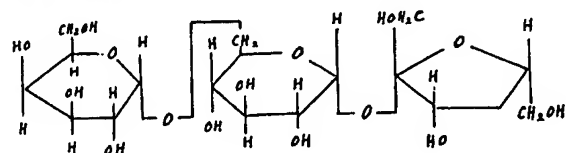
油脂の酸化は過酸化物を生ぜしめ、皮膚障害の原因となることも多い。化粧品としては何よ

(4)

薬理効果が認められる。特にFAEが50%以上の2,4-メチレンシクロアルタノールを含有する時は含水多不飽和脂肪酸の紫外線照射時に於いても抗酸化性が顕著であり、又50%以上のシクロアルタノールを含有する時は皮膚の脂腺賦活剤としての薬理的效果が顕著である。又FAEが1%以上のシクロオイカレノールを含有するときは製品にパール状の光沢を与える。

又ソルコセリルは優れた保湿能、吸湿能を有し、これを配合した化粧品組成物の製品は「使用後の肌のしつとり感」、「肌のなめらかさ」又「化粧のり」等の効果が得られ、又潰瘍、外傷等の治療、内芽形成等の薬理効果がある。

本発明に使用するラフィノーズは甜菜、綿実中に含まれ、又蔗糖をとる場合のステッフエン廃液中にも含まれている三糖類でその構造は次の通りである。



(6)

(5)

即ち三糖類の一種でD-ガラクトース、D-グルコース、D-フルクトース1分子ずつからなる。構造は蔗糖分子中のD-グルコースの6位炭素原子にD-ガラクトピラノースが α -グリコシド結合したものに相当する。本発明の組成物に使用するラフィノーズエステル RAFFI-140 はラフィノーズとミリスチン酸を主とする、高級飽和脂肪酸エステルで本品を乾燥したものを定量するときは、ミリスチンラフィノーズ90%以上を含み、ラフィノーズ1分子に結合するミリスチン酸の分子数は1.0~1.6の範囲にある。

又 RAFFI-180 はラフィノーズとステアリン酸を主とする高級飽和脂肪酸のエステルで本品と乾燥したものを定量するときは、ステアリン酸ラフィノーズ90%以上を含み、ラフィノーズに結合するステアリン酸の分子数は1.0~1.6の範囲にある。又本発明の化粧品組成物に使用する蔗糖脂肪酸エステルは化粧品原料品質基準によつて定められた品質を有する製品であ

(7)

このFAEは米糠油のアルカリ油滓からメタノール、アセトン等の溶剤を用いて反覆抽出を行うことによつてステロールの種類と含量の異つた混合物を得ることが出来る。

FAEは元来非水溶性であり、又油脂に対する溶解度も一旦抽出結晶化したものゝ再溶解は或る一定量以上の場合なかなか困難である。FAEを化粧品等に配合する場合、製品100gr.に対し10mg程度迄は使用するラフィノーズエステルに直接溶解して配合出来る。この場合蔗糖エステルとの併用は有効で、比較的困難な2,4メチレンシクロアルタノールの場合でも均質な製品を得ることが出来る。しかしFAEの配合量が多い場合は時日の経過と共に結晶して製品に析出してくるおそれがある。従つて一定以上の場合には予め他の助剤に溶解してから、ラフィノーズエステルに溶解する必要がある。10mg~100mgの場合は米糠油の炭素数20以上の脂肪酸のエチルエステルに予め溶解してからラフィノーズエステルに溶解して配合する。

(9)

る。

FAEは米糠油のアルカリ油滓から採取されたものでステロール類のフェルラ酸エステルの混合物である。この混合物は従来オリザノールと命名され、初めは単一化合物と考えられていたが、このオリザノールには薬理的効果を有するものと、有しないものがあり、この薬理的効果を有するものを γ -オリザノールとしていた。その後の研究でオリザノールは単一化合物でなく、数種のトリテルペンアルコールのフェルラ酸エステルの混合物であることがわかり、その含有するステロールの種類と量によりいろいろの性質を示すことがわかつた。

即ち50%以上の2,4メチレンシクロアルタノールを含有する時は、含水多不飽和脂肪酸に対する紫外線照射時の抗酸化性が顕著であり、又50%以上のシクロアルタノールを含有する時は皮脂腺賦活剤としての薬理的効果がすぐれ、又1%以上のシクロオイカレノールを含有する時は製品にパール状光沢を与える。

(8)

100mg~1000mgの場合は助剤として米糠油の酸性物質のエステル即ち不飽和脂肪酸のグリセライドを使用し、又1000mg以上の場合には予め小麦の胚芽油に溶かし、更にこれを油溶剤として1,3ブチレングリコールで稀釈したものをラフィノーズエステルに溶解して配合する。

本発明の化粧品組成物に使用するソルコセリルはスイスのソルコパーゼル社から輸入したもので、発育最盛期の幼牛の細内系を賦活し、その全血を採取し、抽出のための予備操作を行つたのち、抽出し、蛋白、発熱性物質、抗原性物質を除き、濃縮して製造したもので、保存剤としてメチルパラベン0.18%およびプロピルパラベン0.02%を添加したものである。本品は淡かつ色透明な液体であるが、本化粧品組成物に配合する場合にはこれを凍結乾燥して使用する。

ソルコセリルは既に医薬品として輸入が承認され、外傷、火傷、手術創の肉芽形成促進治療

に利用されているが又極めて優れた保湿能，吸湿能を有し，吸湿能はプロピレングリコール，グリセリンに匹敵し，また低湿度下に放置しても重量低下が認められず，保湿能が優れていることを示す。従つてこれを配合した化粧品は「使用後の肌のしつとり感」「肌のなめらかさ」「化粧のり」等の効果が得られる。

以上本発明を実施するに際しては前記のラフィノーズエステル，蔗糖脂肪酸エステル及びソルコセリルを化粧用の原料，助剤，添加物等と混合し，クリーム，乳液，パック，ローション等の皮膚化粧品とする。ラフィノーズエステル及び蔗糖脂肪酸エステルの含量はクリーム，乳液の場合はそれぞれ2～4部パックの場合は0.5～1部化粧水の場合は0.1～0.2部ソルコセリルの含量はクリーム，乳液の場合3部パックの場合5部化粧水の場合3部が望ましい。

01

C	FAE	0.01
	青色1号(0.1%水溶液)	0.08
	ソルコセリル	3.0
D	調合香料	0.3

100.0

(A)を80℃に加熱混合する。別に予めFAEを溶かしたRAFFI-140，RAFFI-180含有する(B)を85℃に加熱溶解したものを前者に加え80℃に保ち乍ら30分間攪拌した後，攪拌しながら徐々に冷却し60℃で(C)を加える。更に50℃で(D)を加え30℃迄攪拌冷却し一昼夜放置後容器に充填し製品とする。

実施例 2 モイステャークリーム

ステアリン酸	3.0
鯨ロウ	3.0
ミツロウ	1.0
ベヘニルアルコール	2.0
パチルアルコール	1.0
スクワラン	5.0

実施例 1 クリーム

A	セタノール	2.5
	鯨ロウ	2.0
	スクワラン	8.0
	オクチルドデカノール	5.0
	ラノリン	1.0
	アボガード油	1.0
	ステアリン酸	2.0
	酢酸-dL-α-トコフェロール	0.2
	蔗糖脂肪酸エステル	3.5
	バラオキシ安息香酸ブチル	0.1
B	バラオキシ安息香酸プロピル	0.05
	雲母チタン	0.25
	精製水	62.08
	濃グリセリン	5.0
	バラオキシ安息香酸メチル	0.1
	グリコン酸クロルヘキシジン液(20%水溶液)	0.2
	ヒノキチオール	0.03
	RAFFI-140	1.6
	RAFFI-180	2.0

02

A	パルミチン酸イソステアリル	5.0
	イソセチルイソステアレート	4.0
	イソステアリン酸	2.0
	フェルラ酸トリテルペンアルコールエステル	1.0
	ステアリン酸グリチルレチニル	0.05
	小麦胚芽油	5.0
	バラオキシ安息香酸ブチル	0.1
	バラオキシ安息香酸プロピル	0.05
	RAFFI-180	2.3
	蔗糖脂肪酸エステル	2.0
B	モノオレイン酸グリセリン	1.0
	モノステアリン酸グリセリン	1.0
	テトラオレイン酸ポリオキシエチレンソルビット(40F.O.)	0.5
	トリステアリン酸ポリオキシエチレンソルビタン(20E.O.)	1.0
	バラオキシ安息香酸メチル	0.15
	1,3ブチレングリコール	3.0
	ホウ砂	0.2
	アラントインソジウム-dL-ピロリドンカルボキシレート	0.3
	精製水	52.26

04

C	PPRA	0.01
	グルコン酸クロルヘキシジン (20%水溶液)	0.2
	調合香料	0.3
	アテロコラーゲン(2%液)	0.5
D	ソルコセリル	3.0
	赤色3号(0.1%水溶液)	0.08
		100.0

小麦胚芽油を82℃で加熱しながらFAEをこれに投入して溶解し、次にRAFFI-180及び蔗糖脂肪酸を入れ、次に(A)の残余のものを加えて82℃で加熱攪拌溶解する。

別に(B)を85℃で加熱攪拌溶解する。次に(A)を攪拌しながら(B)を徐々に加え80℃で乳化させ、その後攪拌しながら冷却し、38℃で(C)と(D)を加え30℃迄冷却し、一昼夜放置したものを容器に充填して製品とする。

実施例 3 バック

1.	ステアリン酸	0.53
2.	トリエタノールアミン	0.03
3.	精製水	67.12
4.	RAFFI-140	0.8
5.	蔗糖脂肪酸エステル	1.0
6.	フェルラ酸トリテルペンアルコール エステル	0.01
7.	ヒノキチオール	0.03
8.	濃グリセリン	2.0
9.	アラントイン	0.1
10.	バラオキシ安息香酸メチル	0.1
11.	グルコン酸クロルヘキシジン液 (20%水溶液)	0.25
12.	ポリビニールアルコール	19.0
13.	ナチュロン2×IPA	0.5
14.	エタノール	3.3
15.	調合香料	0.15
16.	ソルコセリル	5.0
17.	青色1号(0.1%水溶液)	0.08
		100.0

04

- 1) 1を80℃に加熱する、別に2と3の一部を85℃に加熱し、これを前者に加え混合し25℃迄冷却する。
- 2) 4及び5を60℃に加熱し、これに6及び7を加え攪拌混合し、更に8, 9, 10, 11を加え攪拌したものを3の残量に加え攪拌混合するこの液に12を徐々に加え80℃迄加熱攪拌溶解させ60℃迄冷却する。次に(2)の液に(1)及び13を加え30℃迄攪拌冷却し14, 15の混液を加え攪拌しながら16及び17を加え濾布で濾過したものを容器に充填して製品とする。

実施例 4 乳液

A	スクワラン	2.0
	オクチルドデカノール	2.0
	ステアリン酸	5.0
	セタノール	1.2
	鯨ロウ	2.0
	乳酸セチル	0.5
	蔗糖脂肪酸エステル	3.0
		100.0

04

B	アボガート油	1.0
	バラオキシ安息香酸ブチル	0.1
	バラオキシ安息香酸プロピル	0.05
	精製水	70.49
	濃グリセリン	5.0
	バラオキシ安息香酸メチル	0.1
	グルコン酸クロルヘキシジン液 (20%水溶液)	0.2
	ヒノキチオール	0.03
	RAFFI-140	1.8
	RAFFI-180	2.1
C	フェルラ酸トリテルペンアルコール エステル	0.01
	青色1号 (0.1%水溶液)	0.12
D	調合香料	0.3
		100.0

(A)を80℃に加熱攪拌混合する。予めFAEを溶解せるラフィノーズエステルを配合せる(B)を85℃にて加熱溶解し、これを前者(A)に加え80℃に保ちながら30分間攪拌した後、攪拌

しながら徐々に冷却 60°C で (C) を加える更に
50°C で (D) を加え 30°C 迄攪拌冷却し、一昼夜
放置後容器に充填包装し製品とする。

実施例 5 ローション

1. RAFFI-1320	3.0
2. 蔗糖脂肪酸エステル	0.1
3. アラントイン	0.1
4. エタノール	3.0
5. 濃グリセリン	3.0
6. パラオキシ安息香酸メチル	0.1
7. パラオキシ安息香酸エチル	0.05
8. グルコン酸クロルヘキシジン液 (20%水溶液)	0.25
9. ヒノキチオール	0.03
10. ソルコセリル	3.0
11. 精製水	87.11
12. 調合香料	0.2
13. 青色1号(0.1%水溶液)	0.05
14. 黄色4号(0.1%水溶液)	0.01
	100.0

(9)

は次の如きものを用いた。

1. クリーム

i) アボガード油

ワシナの果実より採取した油脂で、淡
黄色～黄色の透明な油液で、におい及び味
は特異性を有する。

屈折率 N_D^{20} 1.467～1.474 比重 D_{20}^{20}
0.914～0.921 (岸本特殊肝油工業製)

2. モイスタークリーム

i) ベヘニルアルコール ベヘニルアル
コール ($C_{14} \sim C_{22}$) を主体とする高級アル
コール。白色の薄片、粒または塊、わずかに
特異なにおいがある。融点 65～73°C
酸価 1 以下 けん化価 3 以下 水酸基価
165～185 ヨウ素価 3 以下 ベヘニ
ルアルコール 70% 以上

ii) バチルアルコール；本品は淡褐色～淡
黄色の半透明の固体でわずかに特異なにお

いがある。融点 60～68°C 酸価 5 以下
けん化価 30 以下 ヨウ素価 100 以下
水酸基価 250 ± 20 (高級アルコール
工業製)

FAE	0.03
RAFFI-140	3.0
RAFFI-180	1.0
ポリビニルピロリドン	25.0
プロピレングリコール	5.0
ステアリン酸	3.4
エタノール	0.2
精製水	59.67
	100.0

なお実施例中の原料は化粧品品質基準に適合す
るものを用いたが品質基準にない原材料の性状

(10)

iii) バルミチン酸イソステアリル；本品は
イソステアリルとバルミチン酸で合成した
液状のエステルで $C_{34}H_{68}O_2$ 508.32
常温において無色透明な液でにおいはな
いか、またはわずかに特異なにおいがある。
酸価 1 以下 けん化価 105～115
沃素価 1 以下 水酸基価 3 以下 比重
0.8490～0.8590 (30/30°C)
(日本サーファクタント工業製)

iv) イソセチル イソステアレート

イソステアリン酸イソセチル $C_{17}H_{35}COOC_{16}H_{33}$
508.92 無色～微黄色の液体でにお
いはないか、わずかに特異なにおいがする。
酸価 1.0 以下 けん化価 100～120
沃素価 2.0 以下 (日本サーファクタント
工業製)

(11)

(12)

V) ステアリン酸グリチルレチニル

本品を乾燥したものを定置するときは、
3-ステアロイロキシ グリチルレチニク
酸 ($C_{48}H_{98}O_8$) 95%以上を含む、
白色～微黄色の結晶粉末でにおいや味はほ
とんどない。融点 $218 \sim 225^\circ\text{C}$
(丸善製薬株式会社製)

VI) 小麦胚芽油

本品は小麦胚芽を加熱圧搾して得た油で
あり、淡黄色透明液体でわずかに油臭を有
する。比重 $0.915 \sim 0.925$ 酸価 1 以
下 けん化価 $1.87 \sim 1.93$ 不飽和価 2
%以下 灰素価 130 以下 エスベリス社
(イタリア) 製

VII) トリステアリン酸ポリオキシエチレン
ソルビタン (20. E. O.)

本品は主としてトリステアリン酸ソルビ
タンの遊離の水酸基に酸化エチレンを付加
重合して得られる非イオン界面活性剤で硫
黄色～黄色のワセリン様またはろうようの

物質でわずかに特有なにおいがある。酸価
4 以下。

VIII) アラントイン ソジウム-dL-ピロリ
ドンカルボキシレート

本品はアラントイン ($C_4H_4N_4O_3$) と dL-
ピロリドンカルボン酸ナトリウム
($C_5H_6NO_3-Na$) とを等モルの割合で付加
結合して得られ、本品を定置するときはア
ラントイン ソジウム-dL-ピロリドン
カルボキシレート ($C_{11}H_{12}N_4O_6Na$ 309.22)
として 97%～103%を含む。自己吸湿性
の粉末でにおい及び味はない。
融点 207°C pH: 本品 4g を水を加えて
100ml とした懸濁液の pH は 5～7 であ
る (川研ファインケミカル株式会社製)

IX) PPRA

セルチニン スピシユーム 本品は下記
植物の花粉より抽出されたアミノ酸 (シス
チン, セリン, グリシン, スレオニン, ア
ラニン, バリンロイシン, ヒスチジン, ア

24

24

ルギニン, アスパラギン酸, アスパラギン
グルタミン, ジリン) で定置するときは総
窒素 (N: 14.010) 0.8%～0.9% を含
む。暗茶色芳香のある物質でわずかに酸味
がある。水, グリセリン ソルビトール溶
液及び殆ど化粧品の酸化剤にとけやすい
が、鉱油, グリース油, エーテル, クロロ
ホルムに溶けにくい。pH 4.0～4.2 (10
%水溶液) スウエーデン A B セレネ社製

X) アテロコラーゲン

本品は若い牛の真皮組織をペプシン処理
し、抽出精製されたテロペプタイドのとれ
たコラーゲン (アテロコラーゲン) を再溶
解し、無水コハク酸で処理し抽出されたコ
ラーゲンの 2% の水溶液であり、本品を定
置するとき (N: 14.010) を 0.3%
～0.4% 含む。ペースト状の高粘稠物で、
やや不透明である。

3. バック

i) ナチュロン 2X IPA

本品はニシン魚鱗紅胞を採取し精製した
ものをイソプロパノール中に分散した混合
物である。

含有比率 魚鱗箔 22% (重量%)
粧原基 イソプロパノール 78%

性状はパール様光沢を有する分散液で特異
なにおいがある。

ロナパール社 (アメリカ) 製

4.5 前項記載の原料と同じ。

以上のようにして製造した本発明の製品につ
いて動物についての試験を行い、刺激性の殆ん
どないことを確認した。

(1) 皮膚一次刺激性試験

実験材料及び実験方法

1-1 検体

検体は RAFFI-140, RAFFI-180, 蔗糖脂
肪酸エステル, FAE 及びソルコセルを配

合した製品群即ちクリーム製品、パック製品、乳液製品及び化粧水製品である。製品の配合はそれぞれ実施例のとおりであり、その中のRAFFI-140, RAFFI-180, 蔗糖脂防酸エステルFAE及びソルコセルルの配合量は次の通りである。

	RAFFI-140	RAFFI-180	蔗糖脂防酸 エステル	FAE	ソルコセルル
クリーム	1.6	2.0	3.5	0.01	3.0
モイスター クリーム		2.3	2.0	1.0	3.0
パック	0.8		1.0	0.01	5.0
乳 液	1.8	2.1	3.0	0.01	3.0
化 粧 水	0.09	0.03	0.1	0.0009	3.0

重量%

1-2 実験動物

体重336gr ~ 407gr (平均体重366gr) のハートレー系雌モルモットを1製品につき3匹計15匹を実験に供した。検体適用部位を1匹につき脊椎中線の

(2)

紅斑なし	-
ごく軽度の紅斑あり (かろうじて認められる程度)	±
明らかな紅斑あり	+
浮腫を伴う紅斑あり	++
発疹を伴う紅斑あり	+++

1-4-1 クリーム・モイスタークリーム

判 定	健 常 皮 膚			角 層 剝 離 皮 膚		
	時 間			時 間		
	4	24	48	4	24	48
-	3	3	3	3	3	3
±						
+						
++						
+++						

左右それぞれ3ヶ所ずつ計6ヶ所に設け、右側3ヶ所を健常皮膚、左側3ヶ所を角層剝離皮膚とした。健常皮膚、角層剝離皮膚共検体適用24時間前に電気バリカンにて剪毛後電気カミソリにて刈毛した。角層剝離皮膚は刈毛後セロテープで角層を剝離して用いた。

1-3 試験方法

クリーム、乳液類及びパックの各検体は0.1grを化粧水は0.05mlをパッチテスト用絆創膏(鳥居薬品株式会社製)ミニサイズの各布部分に均一に塗布し、これをモルモットの上背部皮膚に24時間貼布した。貼布24時間後パッチテスト用絆創膏を除去した。

1-4 判定方法

貼布24時間後にパッチテスト用絆創膏を除去し、除去4時間、24時間、48時間後に皮膚を観察した。

(2)

1-4-2 パック

判 定	健 常 皮 膚			角 層 剝 離 皮 膚		
	時 間			時 間		
	4	24	48	4	24	48
-	2	3	3	2	3	3
±	1			1		
+						
++						
+++						

1-4-3 乳 液

判 定	健 常 皮 膚			角 層 剝 離 皮 膚		
	時 間			時 間		
	4	24	48	4	24	48
-	3	3	3	1	3	3
±				2		
+						
++						
+++						

(2)

(2)

1-4-4 化粧水

判 定	健常皮膚			角層剝離皮膚		
	時 間			時 間		
	4	24	48	4	24	48
-	3	3	3	2	3	3
+				1		
++						
+++						

1-4-5 結 論

クリーム、パック、乳液、化粧水各製品ともに健常皮膚、角層剝離皮膚に対する一次刺激はないと考えられる。

(2) 光毒性試験

(1)の皮膚一次刺激試験と同様の検体を作成し、貼布24時間後パッチテスト用絆創膏を除去し、すべての動物をFL-20-BLBランプ6

灯を併列使用し光源より7.5 cmの距離で40分間照射した。

次にFL-20-SBランプ3灯、FL-20-SDランプ3灯を交互に併列配置し、光源より7.5 cmの距離で40分間照射した。

使用したランプの波長領域および放射照度は次のとおりである。

2-1 波長領域

a) FL-20-BLB (東芝製)

波長幅330~430 nm ピーク波長
360 nm 20 W

b) FL-20-SB (東芝製)

波長幅310~610 nm ピーク波長
400 nm 20 W

c) FL-20-SD (東芝製)

波長幅360~700 nm ピーク波長
480 nm 570 nm 20 W

(3)

(3)

2-2 放射照度 (Topcon 製紫外線強度計 UVR-365 を用いて測定した)

- a) FL-20-BLB ランプ6灯を併列使用、光源より7.5 cmの距離にした時の測定照度は5400 $\mu\text{W}/\text{cm}^2/\text{sec}$ である。
- b) FL-20-SB ランプ3灯、FL-20-SD ランプ3灯を交互に併列使用、光源より7.5 cmの距離で測定した時の放射照度は800 $\mu\text{W}/\text{cm}^2/\text{sec}$ である。照射に当っては金属製のカゴにモルモット3匹を入れ、光源より7.5 cmの距離になるようにカゴの位置を設定した。

2-3 判定方法

パッチ除去後皮膚を観察し、次で光照射直後、24時間及び48時間後に皮膚を観察した。皮膚判定の基準は1-4の場合と同様である。

2-4 結 果

クリーム、パック、乳液、化粧水各製品ともに健常皮膚、角層剝離皮膚に対する、光毒性の試験結果は、光照射前、光照射直後、24時間後、48時間後何れも紅斑は認められなかった。即ち光照射による皮膚一次刺激は殆んどないと考えられる。

次にFAEの抗酸化作用に就ては(梶塚進; 学苑344 (1967) 昭和42年10月)に又皮脂腺に対する局所作用に就ては(小林 美恵; 皮膚第21巻第1号 昭和54年2月)等に記載されている。前者ではFAEは一般に使用されている油脂の抗酸化剤に比較して、高温処理の場合特に著しい効果があり、高温(180℃)附近で処理した油脂に対するPOVの変化の試験効果が記載されている。後者にはFAEの外用が臨床的に皮脂腺機能低下を呈する乾皮症に有効であり、若年者にacne (にきび)を誘発することを認めたので、FAE

は皮脂腺の機能に何らかの影響を及ぼすものと考え、生化的及び組織学的な検索を企て、またFAEの抗酸化作用にも着目して、試験管による実験を行つたことが記載されており、又リノール酸の紫外線照射による過酸化脂質生成実験において、FAEはその生成の抑制作用を示したことを述べている。皮脂腺の賦活には特にステロールとしてシクロアルテノールが有効である。化粧品に使用される油脂類は精製されても完全には水分の除去は困難であり、この含水性により紫外線の影響を受け易くなるがFAEの使用は抗酸化性を助長し、特にステロールのうち2,4メチレンシクロアルタノールがFAEの50%以上であるときは、その効果が著しい。

(3) 多不飽和酸におけるFAEの抗酸化性

試験：大豆油におけるFAE混合物の抗酸化性

試料

1. 大豆油 (油糧株式会社)
2. FAE混合物

大豆油の脂肪酸の組成%

大豆油	飽和脂肪酸	オレイン酸	リノール酸	リノレイン酸
	16.2	23.5	52.4	6.8

FAEの組成%

	カンベ ステロール	ステイグマ ステロール	シト ステロール	シクロ オйка ノール	シクロ アルテ ノール	2,4メチレ ンシクロ アルタ ノール	シクロ プラ ノール
No. 1	28.0	7.73	26.79	—	14.62	22.87	—
No. 2	13.54	—	3.73	3.23	22.40	57.11	—
No. 3	No. 1のアセチル化物						
No. 4	No. 2のアセチル化物						

操作法

FAE及びそのアセチル化物を大豆油に0.1%

添加し 1) 含水 2) 45℃ 3) 紫外線

照射

上記三つの場合のPOVの変化をみた。

(6)

(5)

期間 (日)		0	2	5	8	11
含水	コントロール	0.9	1.2	1.3	1.5	1.5
	No. 1	0.5	1.0	1.4	1.2	1.3
	2	0.7	1.4	1.2	2.1	1.5
	3	0.7	1.2	1.3	1.6	1.9
	4	0.6	1.4	1.0	1.8	1.9
45℃	コントロール	1.0	1.7	1.7	1.7	1.9
	No. 1	0.7	1.2	1.3	1.6	2.1
	2	0.8	1.9	1.5	1.6	1.8
	3	0.8	1.3	1.6	1.7	2.1
	4	0.7	1.3	1.1	1.6	1.7
含水紫外線照射	コントロール	0.7	2.7	4.5	9.6	30.3
	No. 1	0.6	2.2	4.4	6.2	14.7
	2	0.8	2.4	4.7	6.2	12.3
	3	0.7	4.2	28.6	38.9	76.9
	4	0.8	3.2	25.9	25.7	47.8

(m eq/kg)

紫外線照射の結果大豆油に於いてFAEの抗酸化性が認められ、期間の経過と共にステロールが2,4メチレンシクロアルタノール50%以上のものの効果が増大する。

(7)

(4) ソルコセリルの保湿能、吸湿能試験

4-1 実験試料及び実験方法

i) 実験試料

- a) ソルコセリル
- b) グリセリン
- c) プロピレングリコール

上記各試料をウォーターバスで水分を蒸発させた後、105℃4時間乾燥したものを実験試料とした。

ii) 実験方法

- a) 直径約4.5cmの秤量瓶に試料約1gを精秤し、20℃相対湿度58%の

(8)

4-2 実験結果

- (1) 保湿力試験：20℃、相対湿度32%
での保湿力（重量減少率で表わす）を表
1に示す。

表 1

	重量変化 (%)					
	1時間	3時間	5時間	7時間	12時間	24時間
ソルコセリル	-0.004	-0.011	-0.016	-0.021	-0.026	-0.034
グリセリン	-0.003	-0.013	-0.025	-0.036	-0.064	-0.084
プロピレン グリコール	-0.012	-0.037	-0.063	-0.090	-0.179	-0.214

- (2) 吸湿力試験(1) 20℃、相対湿度79%
の条件での吸湿力（重量増加率で表わ
す）を表2に示す。

表 2

	重量変化 %					
	1時間	3時間	5時間	7時間	12時間	24時間
ソルコセリル	0.034	0.080	0.117	0.151	0.486	0.740
グリセリン	0.040	0.101	0.153	0.198	0.658	1.012
プロピレン グリコール	0.030	0.091	0.136	0.177	0.695	1.080

環境条件に放置し、恒量に達したもの
につき次の実験を行つた。

- b) 保湿力試験：20℃ 相対湿度 32%
吸湿力試験(1)：20℃ 相対湿度 79%
吸湿力試験(2)：20℃ 相対湿度 98%

- c) 測定時間は1, 3, 5, 7, 12, 24時間と
した。

- d) 環境条件の設定

下記の飽和塩水溶液をデシケーター
に入れ、20℃の恒温室に放置した。

20℃ 相対湿度	飽和塩水溶液
98%	硝酸鉛 ; $Pb(NO_3)_2$
79%	塩化アンモニウム ; NH_4Cl
58%	臭化ナトリウム ; $NaBr \cdot 2H_2O$
32%	塩化カルシウム ; $CaCl_2 \cdot 6H_2O$

(3)

4-3 結 論

表1～3からわかるように吸湿力におい
てはグリセリン、プロピレングリコールに
やや劣るがほぼ匹敵し、保湿力に於いては
両者よりも勝れている。

以上のように本発明の化粧品組成物は化粧品
として安定で、皮膚刺激を与えず、変異原性が
なく、又皮脂腺賦活にも効果があり、又抗酸化
性を有し、pHの広い範囲に亘つて安定で使用感
のすぐれた化粧品を与えることが出来る。

代 理 人

弁理士 塩 崎 正 広

THIS PAGE BLANK (USPTO)